

WO9961029A1: SLEEP INDUCING AGENT

[View Images \(24 pages\)](#) | [View Cart](#)

Premium Data 1: [PDF \(~2286 KB\)](#) | [TIFF \(~1800 KB\)](#) | [Fax](#) | [More choices...](#)

Inventor(s): **TANAMI, Tohru**, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash. Japan
KAMEO, Kazuya, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash. Japan
YAMADA, Kenji, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash. Japan
OKUYAMA, Shigeru, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash. Japan
ONO, Naoya, Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash. Japan

Applicant(s): **SATO, Fumie**, 2-1-901. Kugenumahigashi, Fujisawa-shi, Kanagawa 251-0026, Japan

Issued/Filed Dates: **Dec. 2, 1999 / May 25, 1999**

Application Number: **WO1999JP0002723**

IPC Class: **A61K 031/557; C07C 405/00**

Designated Countries: AU, CA, CN, JP, KR, US. **European patent:** AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE

Abstract: A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by (CH₂)_m, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH₂ or S(O)_nCH₂, R₁ is a C₃-10 cycloalkyl group, a C₃-10 cycloalkyl group substituted with a C₁-4 alkyl group, a C₄-13 cycloalkylalkyl group, a C₅-10 alkyl group, a C₅-10 alkenyl group, an C₅-10 alkynyl group or a bridged cyclic hydrocarbon group, R₂ represents a hydrogen atom, a C₁-10 alkyl group or a C₃-10 cycloalkyl, m is an integer of 1 to 3, and n is 0, 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt or hydrate thereof.

[\[Show "fr" Abstract\]](#)

Representative image:

[View Images](#)



[\[Show "fr" image\]](#)

Attorney, Agent, or Firm:

KITAGAWA, Tomizo:

Foreign References:

none

(No patents reference this one)



Alternate Searches

123

[Patent Number](#)

0

[Boolean Text](#)

1

[Advanced Text](#)

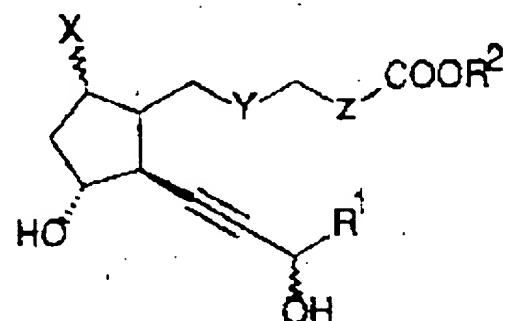
[Nominate this invention](#)

PatentMaven SEARCH PATENT FULL TEXT

BEST AVAILABLE COPY

(57)要約

式



(式中、Xはハロゲン原子を示し、Yは $(\text{CH}_2)_n$ で表
シスビニレン基又はフェニレン基を示し、Zはエチレン
スピニレン基、 OCH_2 又は $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2$ を示し、 R^1
シクロアルキル基、 C_{1-14} のアルキル基で置換された C_1
アルキル基、 C_{1-14} のシクロアルキルアルキル基、 C_1
ル基、 C_{1-10} のアルケニル基、 C_{1-10} のアルキニル基又
炭化水素基を示し、 R^2 は水素原子、 C_{1-10} のアルキル基
のシクロアルキル基を示し、mは1～3の整数を示し、
又は0を示す。)

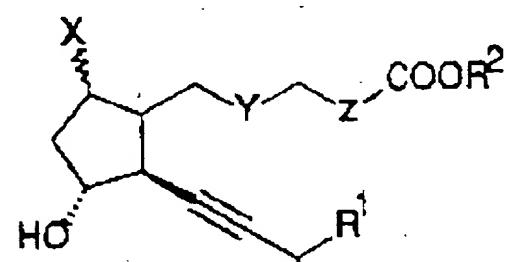
で表されるモノスタグラシン誘導体又はその薬理学的
の薬及び本和物を有効成分とする睡眠誘発剤、

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使

AU	オーストラリア	DM	ドミニカ	KE	カザフスタン	RI	
AT	オーストリア	ES	エストニア	LC	セントルシア	SI	
AM	アルメニア	ES	スペイン	LT	リヒテンシュタイン	SI	
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LR	スリランカ	SC	
AU	オーストラリア	FR	フランス	LR	リベリア	SC	

(57)要約

式



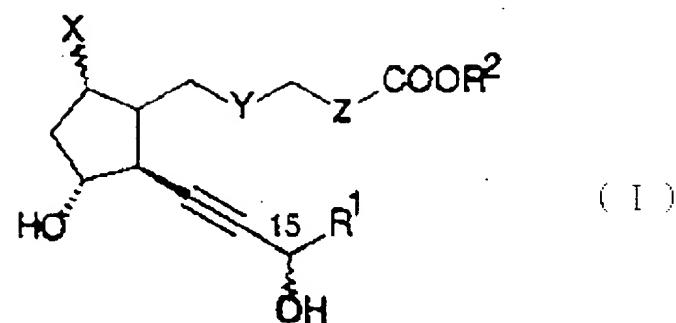


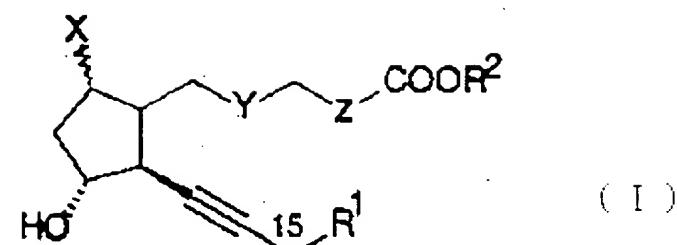
表 1

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 1	β -Cl	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物 2	β -Cl	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 3	β -Cl	CH-CH	0CH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 4	β -Cl	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 5	β -Cl	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 6	α -Cl	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 7	β -Br	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 8	β -Br	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 9	F	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 10	β -Br	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 11	β -Br	CH-CH	0CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 12	β -Br	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 13	β -Br	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 14	β -Cl	CH=CH	SCH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物 15	β -Cl	CH=CH	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 16	β -Cl	CH=CH	0CH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル

WO 99/61029

PC

6



世界知的所有権機関
国際特許局

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6 A61K 31/557, C07C 405/00	A1	(11) 国際公開番号 (43) 国際公開日 1999-05-25 (25.05.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/02723		(72) 発明者；および (75) 発明者／出願人 (米国についての 氏名見亭(TANAMI, Tetsuro)[JP/JP] 龟尾一郎(KAMEO, Kazuya)[JP/JP] 山田憲司(YAMADA, Kenji)[JP/JP] 奥山 俊(OKUYAMA, Shigeru)[JP/JP] 小野直哉(ONO, Naoya)[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番 大正製薬株式会社内 Tokyo, (JP)
(22) 国際出願日 1999年5月25日 (25.05.99)		(74) 代理人 弁理士 北川高造(KITAGAWA, Tomozi) 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番 大正製薬株式会社 特許部 Tokyo, (JP)
(30) 優先権データ 特願平10/142622 1998年5月25日 (25.05.98)	JP	(61) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, US, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, ID, IT, NL, PT, SE, TW, VN
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番1号 Tokyo, (JP)		(添付公開書類) 国際検査報告書
(71) 出願人；および 佐藤実尚(SATO, Fumie)[JP/JP] 〒251-0826 神奈川県藤沢市鵠沼東2-1-901 Kanagawa, (JP)		

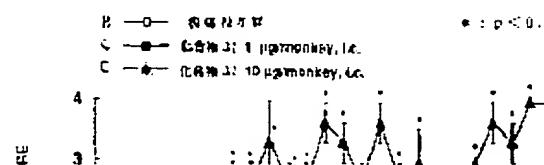
(54) Title: SLEEP INDUCING AGENT

(54) 発明の名称、睡眠誘発剤

(57) Abstract

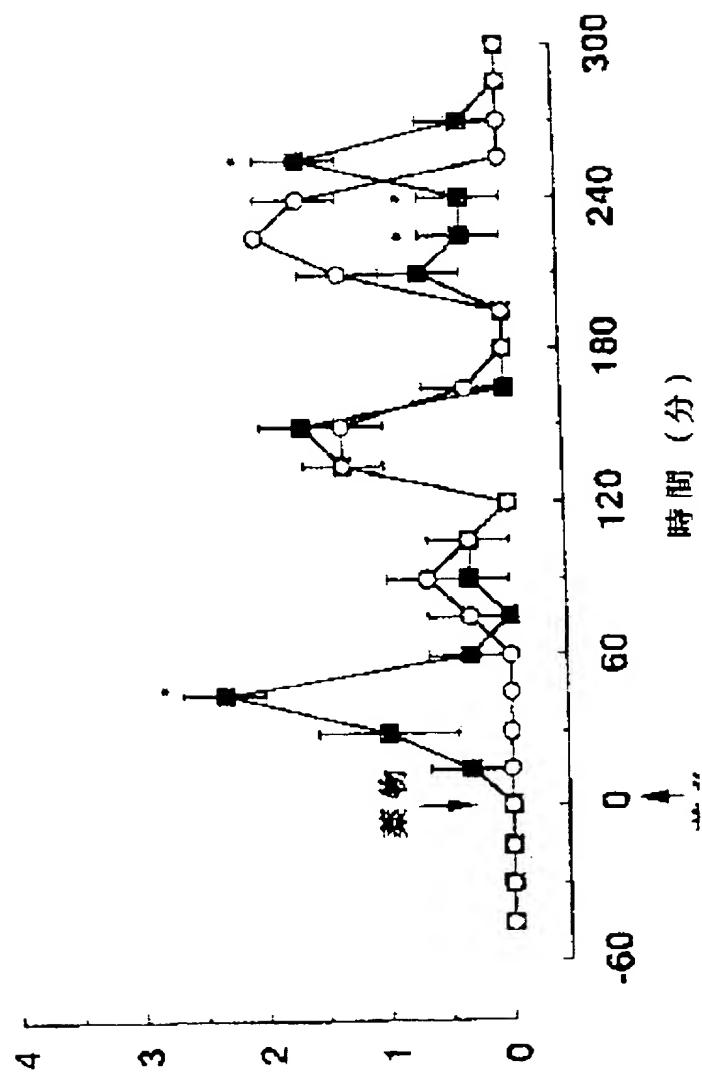
A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by $(CH_2)_m$, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH_2 or $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2$, R^1 is a C_{2-10} cycloalkyl group, a C_{3-10} cycloalkyl group substituted with a C_{1-5} alkyl group, a C_{3-10} cycloalkylalkyl group, a C_{3-10} alkyl group, a C_{3-10}

スコア	0: 0 - 50	△
	1: 60 - 225	△
	2: 225 - 450	△
	3: 450 - 675	△
	4: 675 - 900	△



2 / 2

—○— 細導管与群
 —■— PGD₂ 10 μg/monkey, i.c.
 * : p < 0.05 (對 溶媒授与群)



スルア—	0:	0 - 60	秒
	1:	60 - 225	秒
	2:	225 - 450	秒
	3:	450 - 675	秒
	4:	675 - 900	秒

1 / 2

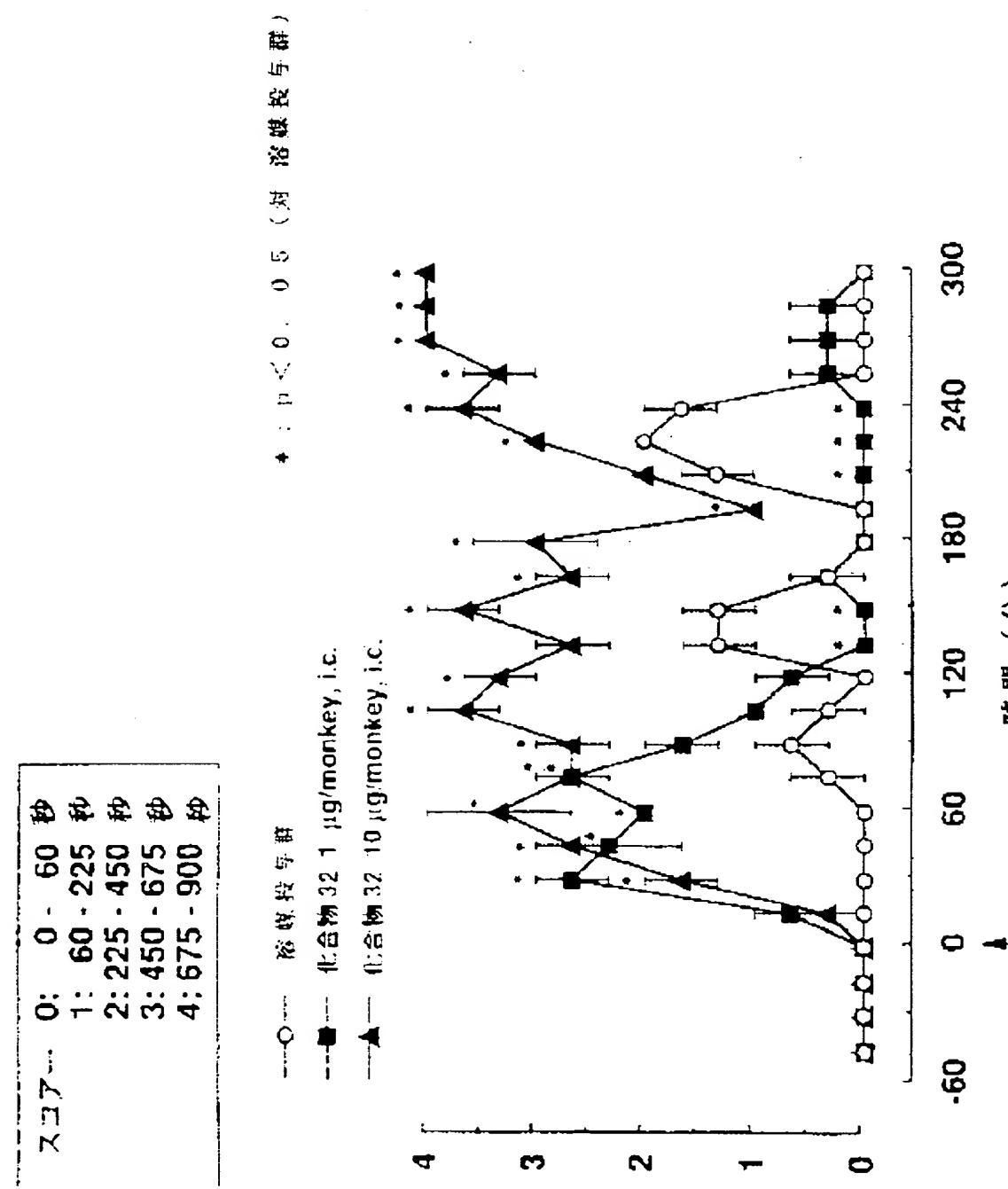


表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 71	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 72	β -Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 73	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	好
化合物 74	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 75	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	好
化合物 76	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシル	水素
化合物 77	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	好
化合物 78	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 79	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	好
化合物 80	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 81	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-メチル-4-ヘキシル	好
化合物 82	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2-メチル-4-ヘキシル	水素
化合物 83	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2, 6-ジメチル-5-ヘプチル	好
化合物 84	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	2, 6-ジメチル-5-ヘプチル	水素
化合物 85	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	1-エチル-3-ヘキシル	好
化合物 86	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	1-エチル-3-ヘキシル	水素

本発明に係る化合物は、経口的に、または静脈内もしくは鼻などに非経口的に投与することができる。これらは、例常の方法により製造することができる錠剤、粉剤、顆粒剤、オラセリ剤、液剤、乳剤、懸濁剤等の形で経口投与するこ

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 71	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH=CH	シクロヘキサ	水素
化合物 72	β -Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH=CH	シクロヘキサ	水素

表1 のつづき

	X	Y	Z	R ³	R ²
化合物45	β-Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	2, 6-ジメチル-5-ヘリル	水素
化合物46	β-Cl	6-(2-フロロエチル)	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物47	β-Cl	m-イソタ-フェニル	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物48	β-Cl	p-イソタ-フェニル	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物49	β-Cl	6-(2-フロロエチル)	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物50	β-Cl	m-イソタ-フェニル	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物51	β-Cl	p-イソタ-フェニル	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物52	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物53	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物54	β-Cl	CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物55	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物56	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物57	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物58	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物59	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物60	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物61	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2-メチル-1-エキシル	水素
化合物62	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2-メチル-1-エキシル	水素
化合物63	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2, 6-ジメチル-5-ヘリル	水素
化合物64	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2, 6-ジメチル-5-ヘリル	水素
化合物65	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	1-メチル-3-ヘキシル	水素
化合物66	β-Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	1-メチル-3-ヘキシル	水素

表1のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物45	β-Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	2, 6-ジ'アチル-5-ヘテ"リル	水素
化合物46	β-Cl	6-(2-フロビン)-	OCH ₂	シクロヘキシル	水素

WO 99/61029

表1のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物19	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物20	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物21	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物22	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物23	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物24	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物25	α -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物26	β -Br	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物27	α -Br	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物28	F	CH ₂ CH ₂	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物29	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物30	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	メチル
化合物31	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	メチル
化合物32	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物33	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物34	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物35	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物36	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物37	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物38	α -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物39	β -Br	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物40	α -Br	CH ₂ CH ₂	SCH ₃	シクロヘキシル	水素

WO 99/61029

7

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 19	β -C ₁	CH ₂ CH ₂	OC ₂ H ₅	シクロヘキシル	水素
化合物 20	β -C ₁	CH ₂ CH ₂	OC ₂ H ₅	シクロヘキシル	水素

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.